

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
7. Juli 2005 (07.07.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2005/061502 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **C07D 487/04**,  
A01N 43/90 // (C07D 487/04, 249:00, 239:00)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/014393

(22) Internationales Anmeldedatum:  
17. Dezember 2004 (17.12.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
10360392.1 19. Dezember 2003 (19.12.2003) DE  
102004003767.1 23. Januar 2004 (23.01.2004) DE  
102004019456.4 19. April 2004 (19.04.2004) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): **BASF Aktiengesellschaft** [DE/DE]; 67056  
Ludwigshafen (DE).

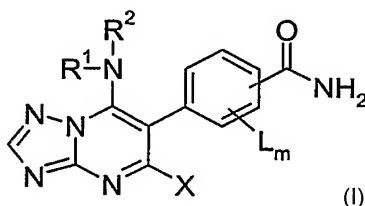
(72) Erfinder; und

(75) **Erfinder/Anmelder (nur für US): TORMO I BLASCO**,  
**Jordi** [ES/DE]; Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudenbach  
(DE). **BLETTNER, Carsten** [DE/DE]; Richard-Wag-  
ner-Str.48, 68165 Mannheim (DE). **MÜLLER, Bernd**  
[DE/DE]; Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal (DE).  
**GEWEHR, Markus** [DE/DE]; Goethestr. 21, 56288  
Kastellaun (DE). **GRAMMENOS, Wassilios** [GR/DE];  
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE).  
**GROTE, Thomas** [DE/DE]; Im Höhnhausen 18, 67157  
Wachenheim (DE). **RHEINHEIMER, Joachim** [DE/DE];  
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen (DE). **SCHÄFER**,  
**Peter** [DE/DE]; Römerstr.1, 67308 Ottersheim (DE).  
**SCHIEWECK, Frank** [DE/DE]; Lindenweg 4, 67258  
Hessheim (DE). **SCHWÖGLER, Anja** [DE/DE]; Hein-  
rich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE). **WAGNER**,  
**Oliver** [DE/DE]; Im Meisental 50, 67433 Neustadt (DE).  
**SCHERER, Maria** [DE/DE]; Hermann-Jürgens-Str.30,  
76829 Godramstein (DE). **STRATHMANN, Siegfried**  
[DE/DE]; Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof (DE).  
**SCHÖFL, Ulrich** [DE/DE]; Erlenstr. 8, 68782 Brühl

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) **Title:** 6-(AMINOCARBONYL-PHENYL) TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHODS FOR THE PRODUCTION THEREOF,  
USE THEREOF FOR CONTROLLING HARMFUL FUNGI, AND SUBSTANCES CONTAINING THE SAME

(54) **Bezeichnung:** 6-(AMINOCARBONYL-PHENYL)-TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG  
UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL



(57) **Abstract:** Disclosed are triazolopyrimidines of formula (I), wherein the substituents have the following meaning: R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> represent hydrogen, alkyl, alkyl halide, cycloalkyl, halocycloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, cycloalkenyl, halocycloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, or phenyl, naphthyl, or a five-membered to six-membered saturated, partially unsaturated, or aromatic heterocycle containing one to four heteroatoms from the group comprising O, N, and S. R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> can also form a five-membered or six-membered heterocyclyl or heteroaryl along with the nitrogen atom to which the same are bonded, said heterocyclyl or heteroaryl being bonded via N, while optionally containing an additional heteroatom from the group comprising O, N, and S as a ring member and being optionally substituted according to the

description; L represents halogen, cyano, alkyl, alkyl halide, alkoxy, alkenyloxy, or alkoxy carbonyl; m represents 1, 2, 3, or 4, the groups L being optionally different if m is greater than 1; X represents halogen, cyano, alkyl, alkyl halide, alkoxy, or haloalkoxy. Also disclosed are methods and intermediate products for producing said compounds, substances containing the same, and the use thereof for controlling plant-pathogenic fungi.

(57) **Zusammenfassung:** Triazolopyrimidine der Formel I in der die Substituenten folgende Bedeutung haben: R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenocycloalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Halogenocycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und gemäß der Beschreibung substituiert sein; L Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy oder Alkoxy-carbonyl; m 1, 2, 3 oder 4, wobei die Gruppen L verschieden sein können wenn m größer als 1 ist; X Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy oder Halogenalkoxy; Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.



WO 2005/061502 A1



(DE). **STIERL, Reinhard** [DE/DE]; Jahnstr.8, 67251 Freinsheim (DE).

(74) **Gemeinsamer Vertreter:** **BASF Aktiengesellschaft**; 67056 Ludwigshafen (DE).

(81) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,

GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

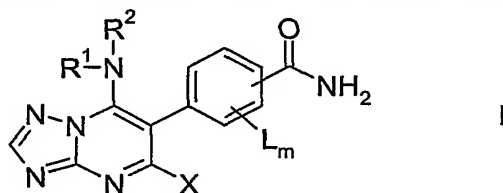
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

6-(Aminocarbonyl-phenyl)-Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

## Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte Triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

- 10  $R^1$ ,  $R^2$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogenycycloalkyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkenyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenycycloalkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkinyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkinyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell un-
- 15 gesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

- $R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N
- 20 und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkenyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkenyloxy, (exo)- $C_1$ - $C_6$ -Alkylen und Oxy- $C_1$ - $C_3$ -alkylenoxy tragen kann;

- 25  $R^1$  und/oder  $R^2$  können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen  $R^a$  tragen:

- $R^a$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy
- 30 Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di- $C_1$ - $C_6$ -alkylamino,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkenyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkenyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkinyl,  $C_3$ - $C_6$ -Alkinyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkinyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyloxy, Oxy- $C_1$ - $C_3$ -alkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, ent-
- 35 haltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

## 2

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R<sup>b</sup> tragen können:

5            R<sup>b</sup>    Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Amino-carbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

15            und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

                 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können.

25    L    Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl;

          m    1, 2, 3 oder 4, wobei die Gruppen L verschieden sein können wenn m größer als 1 ist;

30            X    Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy.

35            Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

Aus EP-A 71 792, EP-A 550 113 sind 5-Chlor-6-phenyl-7-amino-triazolopyrimidine allgemein bekannt. In WO 03/080615 werden 6-Phenyl-Triazolopyrimidine allgemein vor-

## 3

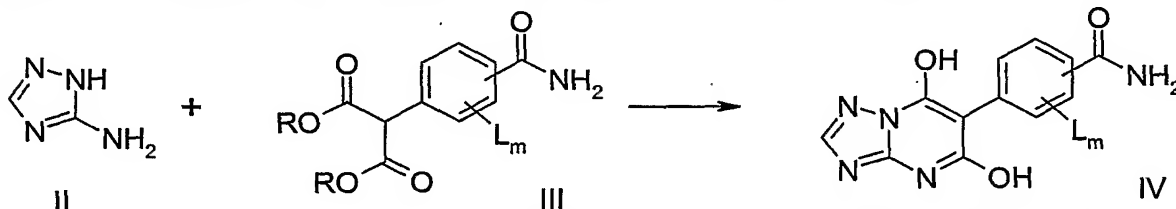
geschlagen, deren Phenylgruppe in para-Stellung eine Alkylamid-Gruppe tragen kann. Diese Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen bekannt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen unterscheiden sich von den in WO 03/080615  
5 beschriebenen durch die Carbonsäureamid-Gruppe als Substituent des 6-Phenyl-  
ringes.

Die Wirkung der bekannten Verbindungen ist jedoch in vielen Fällen nicht zufrieden-  
stellend. Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde,  
10 Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum  
bereitzustellen.

Demgemäss wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des weiteren  
wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel  
15 sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindun-  
gen I gefunden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten  
werden. Vorteilhaft werden sie durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II mit  
20 entsprechend substituierten Phenylmalonaten der Formel III, in der R für Alkyl, bevor-  
zugt für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl steht, dargestellt.



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 80°C bis 250°C, vor-  
zugsweise 120°C bis 180°C, ohne Solvens oder in einem inerten organischen Lö-  
25 sungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 770 615] oder in Gegenwart von Es-  
sigsäure unter den aus Adv. Het. Chem. Bd. 57, S. 81ff. (1993) bekannten Bedingun-  
gen.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlen-  
30 wasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether,  
Nitrile, Ketone, Alkohole, sowie N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Dimethylform-  
amid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung ohne Lösungs-  
mittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Es  
können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

35

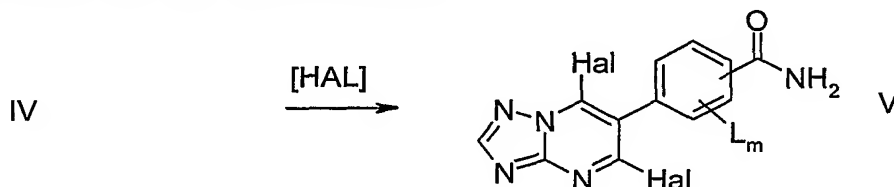
Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkalimetallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate sowie Alkalimetallhydrogencarbonate, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle, Alkylmagnesiumhalogenide sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Triisopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden tertiäre Amine wie Triisopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuss oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die Base und das Malonat III in einem Überschuss bezogen auf das Triazol einzusetzen.

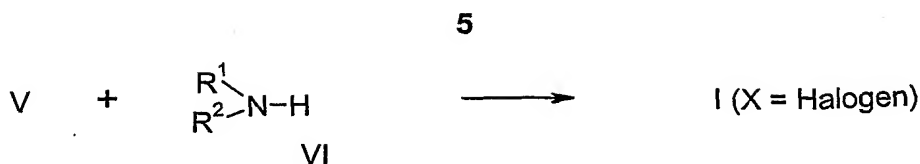
Phenylmalonate der Formel III werden vorteilhaft aus der Reaktion entsprechend substituierter Brombenzole mit Dialkylmalonaten unter Cu(I)-Katalyse erhalten [vgl. Chemistry Letters, S. 367-370, 1981; EP-A 10 02 788].

Die Dihydroxytriazolopyrimidine der Formel IV werden unter den aus WO-A 94/20501 bekannten Bedingungen in die Dihalogenpyrimidine der Formel V überführt, in der Hal ein Halogenatom, bevorzugt ein Brom oder ein Chloratom, insbesondere ein Chloratom bedeutet. Als Halogenierungsmittel [HAL] wird vorteilhaft ein Chlorierungsmittel oder ein Bromierungsmittel, wie Phosphoroxybromid oder Phosphoroxychlorid, ggf. in Anwesenheit eines Lösungsmittels, eingesetzt.



Diese Umsetzung wird üblicherweise bei 0°C bis 150°C, bevorzugt bei 80°C bis 125°C, durchgeführt [vgl. EP-A 770 615].

Dihalogenpyrimidine der Formel V werden mit Aminen der Formel VI,



in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> wie in Formel I definiert sind, zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, weiter umgesetzt.

5 Diese Umsetzung wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO-A 98/46608].

10

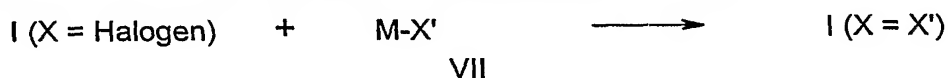
Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganische Basen, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel VI kann als Base dienen.

15

Verbindungen der Formel I, in der X Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy bedeutet, können vorteilhaft aus der Umsetzung von Verbindungen I, in der X Halogen, bevorzugt Chlor bedeutet, mit Verbindungen M-X' (Formel VII) erhalten werden. Verbindungen VII stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat oder ein Halogenalkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt

20

vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel VII hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.



25

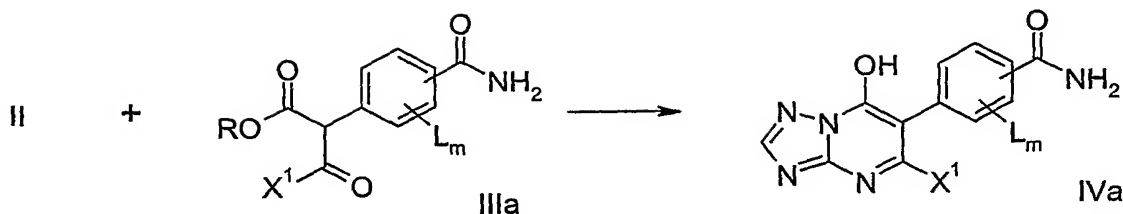
Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol.

30

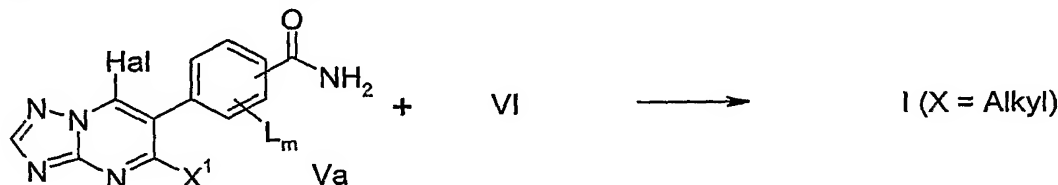
Verbindungen der Formel I, in denen X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht, können vorteilhaft durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:

6



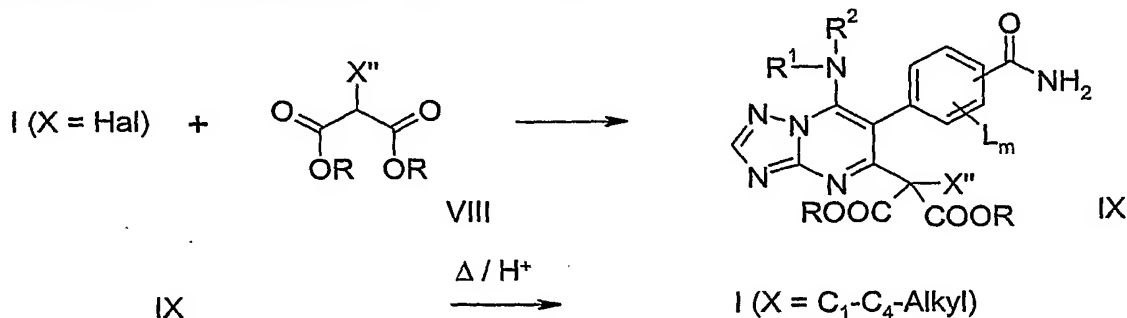
- Ausgehend von den Ketoestern IIIa werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine IVa erhalten. In Formeln IIIa und IVa steht  $X^1$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigestern (IIIa mit  $X^1 = CH_3$ ) werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine erhalten [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen IIIa erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 beschriebenen Bedingungen.

- Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine werden mit Halogenierungsmitteln [HAL] unter den weiter oben beschriebenen Bedingungen zu den 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel Va umgesetzt. Bevorzugt werden Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt. Die Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt werden. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von 0 bis 150°C oder vorzugsweise von 80 bis 125°C.



Die Umsetzung von Va mit Aminen VI erfolgt unter den weiter oben beschriebenen Bedingungen.

- Verbindungen der Formel I in der X  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl bedeutet, können alternativ auch aus Verbindungen I, in der X Halogen, insbesondere Chlor, bedeutet und Malonaten der Formel VIII hergestellt werden. In Formel VIII bedeuten  $X''$  Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_3$ -Alkyl und R  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel IX umgesetzt und zu Verbindungen I decarboxyliert [vgl. US 5,994,360].



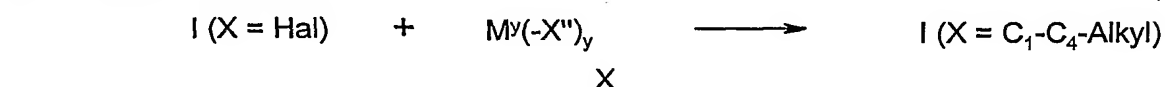


Die Malonate VIII sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

- 5 Die anschließende Verseifung des Esters IX erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen IX vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I bereits ganz oder teilweise erfolgen.
- 10 Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

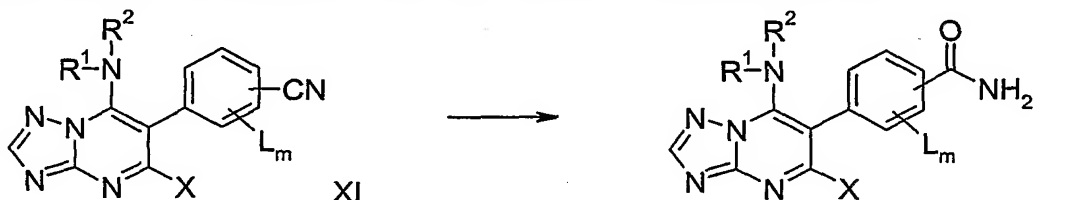
- Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, können auch durch Kuppelung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel I, in der X Halogen bedeutet, mit metallorganischen Reagenzien der Formel X erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.



- In Formel X steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn und X'' für C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

Verbindungen der Formel I können alternativ auch ausgehend von substituierten 6-Cyanophenyl-Triazolopyrimidinen der Formel XI hergestellt werden.



- 5 Diese Umsetzung kann in Anwesenheit von Schwefelsäure bei 0 bis 60°C, insbesondere 20 bis 25°C erfolgen [vgl. Synthetic Commun., 1999, S. 547ff.], alternativ kann die Umsetzung in dem Polyethylenglycol / NaOH – System bei 0 bis 60°C, insbesondere 20 bis 25°C in Anwesenheit eines Lösungs- oder Verdünnungsmittels erfolgen [vgl. Synthetic Commun., 2000, S. 1713ff.], oder mit Harnstoff / Wasserstoffperoxid bei 0 bis 60°C, insbesondere 20 bis 25°C in Anwesenheit eines Lösungs- oder Verdünnungsmittels erfolgen [vgl. Org. Lett. 1999, S. 189ff.].

Verbindungen der Formel XI sind aus WO 03/080615 bekannt, bzw. können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

- 15 Außerdem können die Verbindungen der Formel I durch Pd-katalysierte Aminocarbonylierung [vgl.: Tetrahedron Lett. Bd. 39, 2835-2838 (1998); J. Org. Chem. Bd. 66, 4311 ff (2001); WO 00/37428; DE 35 25 564; J. Org. Chem. Bd. 62, 8640-8653 (1997); JP 2000191612] der entsprechenden Halogenverbindungen XII [vgl. EP-A 550113] oder Triflate XIII hergestellt werden.



XII: Y = Cl, Br, I  
XIII: Y = OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>

20

- Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

25

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

- 5      Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in  
10     der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

15

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

- Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;
- 20     25

- Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4 oder 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;
- 30     35

- Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-but-
- 40

enyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hex-  
 5 enyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Di-  
 10 methyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl,  
 15 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise  
 20 oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B.  
 25 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl,  
 30 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

35 Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

40 fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyc-  
 lus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S;

- 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isotiazolidinyl, 4-Isotiazolidinyl, 5-Isotiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl und 2-Piperazinyl;
  - 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, und 1,3,4-Triazol-2-yl;
  - 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl und 2-Pyrazinyl;
- Alkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 3 bis 5 CH<sub>2</sub>-Gruppen, z.B. CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;
- Oxyalkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;
- Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O;
- In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Raze-mate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste L und R<sup>3</sup> der Formel I.

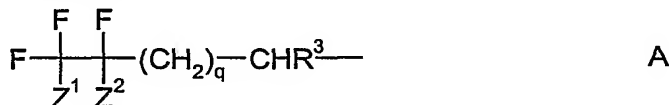
- 5 Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen der Formel I werden bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> nicht Wasserstoff bedeutet.

10

Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl steht.

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für eine Gruppe A steht:



15

worin

Z<sup>1</sup> Wasserstoff, Fluor oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Fluoroalkyl,

Z<sup>2</sup> Wasserstoff oder Fluor, oder

- 20 Z<sup>1</sup> und Z<sup>2</sup> bilden gemeinsam eine Doppelbindung;

q 0 oder 1 ist; und

R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Methyl bedeuten.

Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl steht, welches durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann.

25

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>2</sup> für Methyl oder Ethyl steht.

30

Sofern R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen mit Chiralitätszentrum beinhalten, sind für diese Gruppen die (S)- Isomere bevorzugt. Im Fall halogenfreier Alkyl oder Alkenylgruppen mit Chiralitätszentrum in R<sup>1</sup> oder R<sup>2</sup> sind die (R)-konfigurierten Isomere bevorzugt.

35

Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Piperidiny-, Morpholinyl- oder Thiomorpholinylring bilden, insbesondere einen Piperidinyling, der ggf. durch eine bis drei

## 13

Gruppen Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl substituiert ist. Besonders bevorzugt sind die Verbindungen, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-Methylpiperidinring bilden.

- 5 Ein weiterer bevorzugter Gegenstand der Erfindung sind Verbindungen I, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrazolring bilden, der ggf. durch eine oder zwei Gruppen Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, insbesondere durch 3,5-Dimethyl oder 3,5-Di-(trifluormethyl) substituiert ist.

10

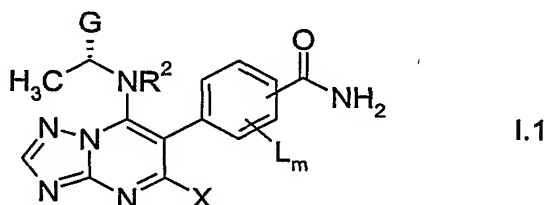
Daneben sind auch Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CF<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)=CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>, Cyclopentyl oder Cyclohexyl; R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl; oder R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CF<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- bedeuten.

15

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen X Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, wie Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy, besonders Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.

20

Eine bevorzugte Ausführungsform der Verbindungen der Formel I betrifft Verbindungen der Formel I.1:



in der

- 25 G C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, insbesondere Ethyl, n- und i-Propyl, n-, sek-, tert- Butyl, und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxymethyl, insbesondere Ethoxymethyl, oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, insbesondere Cyclopentyl oder Cyclohexyl;  
 R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl; und  
 X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

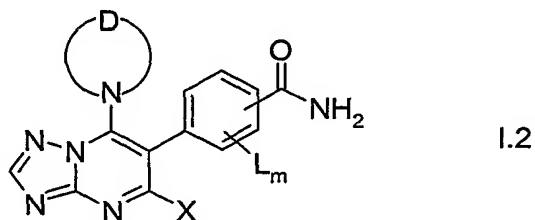
30

Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Verbindungen der Formel I betrifft Verbindungen, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als

- 35 Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,

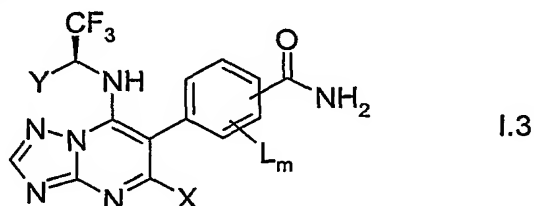
## 14

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann. Diese Verbindungen entsprechen insbesondere Formel I.2,



- 5 in der
- D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und
- 10 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl tragen kann; und
- X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

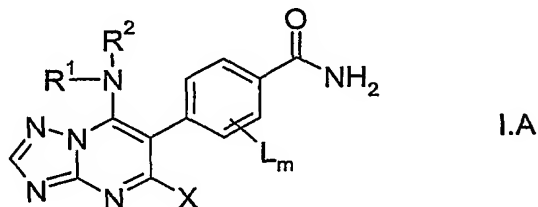
Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Verbindungen der Formel I betrifft Verbindungen der Formel I.3.



- 15 in der Y für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere für Methyl und Ethyl, und X für Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht.

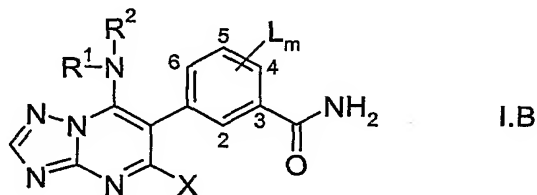
- 20 Verbindungen der Formel I sind besonders bevorzugt, in denen mindestens ein Substituent L ortho-ständig zu der Bindung mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst steht, insbesondere ein Substituent aus Chlor, Fluor oder Methyl.

- 25 Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I, in der die Gruppe C(O)NH<sub>2</sub> in 4-Position steht; die Verbindungen entsprechen Formel I.A.

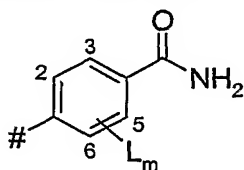




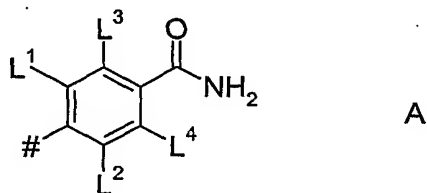
Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I, in der die Gruppe C(O)NH<sub>2</sub> in 3-Position steht; die Verbindungen entsprechen Formel I.B.



Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel I.A, in der die Phenylgruppe



der Gruppe A entspricht:



in der

L<sup>1</sup> Halogen, Halogenmethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere Cl, F oder Methyl;  
 L<sup>2</sup>, L<sup>3</sup>, L<sup>4</sup> Wasserstoff oder Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy bedeuten,

wobei # die Verknüpfungsstelle zu dem Triazolopyrimidin-Gerüst kennzeichnet.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

#### Tabelle 1

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 2

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 3

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 4

10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 5

15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 6

20 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 7

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 8

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 9

30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor-6-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 10

35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor-6-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 11

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor-6-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 12

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor-6-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 13

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 14

10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 15

15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 16

20 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 17

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 18

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 19

30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 20

35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 21

40 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 22

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 23

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 24

10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 25

15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 26

20 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 27

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 28

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 29

30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,5-Difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 30

35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,5-Difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 31

40 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,5-Difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 32

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,5-Difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 33

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,3,6-difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 34

10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor,3,6-difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 35

15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor,3,6-difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 36

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor,3,6-difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 37

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5,6-difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 38

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5,6-difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 39

30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5,6-difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 40

35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5,6-difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 41

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 42

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 43

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 44

10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 45

15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,3,6-Trifluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 46

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,3,6-Trifluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 47

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,3,6-Trifluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 48

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,3,6-Trifluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 49

30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl,5-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 50

35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Methyl,5-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 51

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl,5-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 52

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Methyl,5-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 53

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,5-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 54

10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,5-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 55

15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,5-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 56

20 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,5-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 57

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 58

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Fluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 59

30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 60

35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Fluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 61

40 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,3-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 62

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,3-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 63

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,3-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 64

10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,3-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 65

15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,5-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 66

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,5-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 67

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,5-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 68

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,5-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 69

30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,3,6-Trichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 70

35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,3,6-Trichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 71

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,3,6-Trichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40



## Tabelle 72

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,3,6-Trichlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 73

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,5-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 74

- 10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,5-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 75

- 15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,5-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 76

- 20 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,5-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 77

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 78

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 79

- 30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 80

- 35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 81

- 40 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 82

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Chlor,5-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 83

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor,5-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 84

10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor,5-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 85

15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor,5-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 86

20 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Fluor,5-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 87

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor,5-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 88

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Fluor,5-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 89

30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor,5-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 90

35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Chlor,5-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 91

40 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor,5-methyl,6-fluor und die

## 25

Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 92

- 5 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor,5-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 93

- 10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor,3-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 94

- 15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Chlor,3-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 95

- 20 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor,3-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 96

- 25 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor,3-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 97

- 30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 98

- 35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 99

- Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

spricht

Tabelle 100

5 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 101

10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 102

15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 103

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20 Tabelle 104

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 Tabelle 105

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,5-Dimethyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 106

30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,5-Dimethyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 107

35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,5-Dimethyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 108

40 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,5-Dimethyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 109

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 110

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 111

- 10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 112

- 15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 113

- 20 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 114

- 25 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 115

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 30 Tabelle 116

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 35 Tabelle 117

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,3-methoxy,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 118

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Chlor,3-methoxy,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 119

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor,3-methoxy,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 120

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor,3-methoxy,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 121

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor,5-methoxy,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 122

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Chlor,5-methoxy,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 123

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor,5-methoxy,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 124

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor,5-methoxy,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 125

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-methoxy und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 126

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 127

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 128

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 129

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 130

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 131

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 132

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 133

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 134

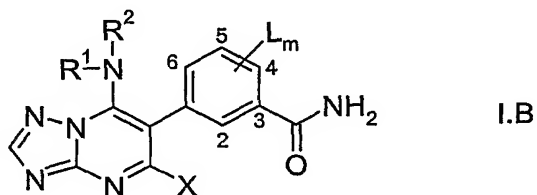
Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 135

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 136

- 10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht



## 15 Tabelle 137

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 138

- 20 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 139

- 25 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 140

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 141

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35



## Tabelle 142

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 143

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 144

- 10 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 145

- 15 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 146

- 20 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Chlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 147

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 148

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 149

- 30 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 150

- 35 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 151

- 40 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 152

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 153

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 154

- 10 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 155

- 15 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 156

- 20 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 157

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 158

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 159

- 30 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 160

- 35 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 161

- 40 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor,  $L_m$  6-Chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 162

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 6-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 163

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 6-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 164

- 10 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 6-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 165

- 15 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 6-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 166

- 20 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 6-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 167

- Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 6-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 168

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 6-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 169

- 30 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor,6-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 170

- 35 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Fluor,6-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 171

- 40 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor,6-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 172

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Fluor,6-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 173

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor,  $L_m$  6-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 174

- 10 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano,  $L_m$  6-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 175

- 15 Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl,  $L_m$  6-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 176

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy,  $L_m$  6-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle A

Nr.	$R^1$	$R^2$
A-1	H	H
A-2	CH <sub>3</sub>	H
A-3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-4	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-5	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-6	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-7	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-8	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-9	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-10	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	H
A-11	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-12	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-13	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-14	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-15	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-16	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-17	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-18	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-19	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-20	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-21	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-22	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-23	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-24	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-25	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-26	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-27	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-28	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-29	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-30	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-31	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-32	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-33	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-34	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-35	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-36	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-37	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-38	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-39	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-40	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-41	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-42	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-43	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-44	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-45	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-46	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-47	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-48	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-49	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-50	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-51	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-52	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-53	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-54	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-55	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-56	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-57	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-58	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-59	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-60	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-61	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-62	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-63	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-64	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-65	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-66	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-67	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-68	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-69	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-70	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-71	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-72	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-73	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-74	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-75	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-76	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
A-77	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-78	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-79	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H
A-80	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-81	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-82	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	H
A-83	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-84	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-85	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
A-86	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-87	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-88	CH <sub>2</sub> -C≡CH	H
A-89	CH <sub>2</sub> -C≡CH	CH <sub>3</sub>
A-90	CH <sub>2</sub> -C≡CH	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-91	Cyclopentyl	H
A-92	Cyclopentyl	CH <sub>3</sub>
A-93	Cyclopentyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-94	Cyclohexyl	H
A-95	Cyclohexyl	CH <sub>3</sub>
A-96	Cyclohexyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-97	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H
A-98	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
A-99	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-100	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -	
A-101	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -	
A-102	-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -CH=CHCH <sub>2</sub> -	
A-103	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-104	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CHFCH <sub>2</sub> -	
A-105	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-106	-CH <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	
A-107	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-108	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-109	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-110	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	
A-111	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	
A-112	-CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -	
A-113	-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	
A-114	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-115	-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-	
A-116	-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	
A-117	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	
A-118	-(CH <sub>2</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-119	-CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	
A-120	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-121	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	
A-122	-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	
A-123	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-124	-N=CH-CH=CH-	
A-125	-N=C(CH <sub>3</sub> )-CH=C(CH <sub>3</sub> )-	
A-126	-N=C(CF <sub>3</sub> )-CH=C(CF <sub>3</sub> )-	

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als

5 Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüse-

10 seepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- 15 • *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- 20 • *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- 25 • *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- 30 • *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Pae-*

35 *cilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid



wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

- 5 Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

- 10 Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 1 bis 1000 g/100 kg Saatgut, vorzugsweise 1 bis 200 g/100 kg, insbesondere 5 bis 100 g/100 kg verwendet.

- 15 Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effektes. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

- 20 Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

- 25 Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

- 30 - Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,
- 35 - Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykoether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenoether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Tristerylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

## 41

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

A Wasserlösliche Konzentrate (SL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem  
5 wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

B Dispergierbare Konzentrate (DC)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter  
10 Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

C Emulgierbare Konzentrate (EC)

15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von  
15 Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

D Emulsionen (EW, EO)

40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von  
20 Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

25 E Suspensionen (SC, OD)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer  
Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

30

F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate  
35 hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei  
40

der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

## 2. Produkte für die Direktapplikation

5

### H      Stäube (DP)

5 Gew.Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

10

### I      Granulate (GR, FG, GG, MG)

0.5 Gew-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

15

### J      ULV- Lösungen (UL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

20

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

25

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereit werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

35

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

40

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

5

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt

10

werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

15

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

20

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin,
- 25   Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, Dinitroconazol, Enilconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol,
- 30   Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- 35   Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol,

- Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- 5    • Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
  - Schwefel
  - Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone,

10   Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid

    - Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,

15   • Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid

    - Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

#### Synthesebeispiele

- 20   Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Daten aufgeführt.

- 25   Beispiel 1 – Herstellung von 5-Chlor-6-(2,6-difluor-4-aminocarbonylphenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]primidin

- 30   Durch eine Lösung von 1,5 mmol 5-Chlor-6-(2,6-difluor-4-cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]primidin [vgl. WO 03/80615] in 20 ml Methanol wurde bis zur Sättigung HCl-Gas eingeleitet. Nach 24 Std. rühren bei etwa 20-25°C wurde der entstandene Niederschlag abfiltriert und in Dichlormethan aufgelöst. Nach Waschen mit Wasser und Trocknung wurde das Lösungsmittel entfernt. Nach Chromatographie an Kieselgel wurden 140 mg der Titelverbindung vom Fp. 197°C und 200 mg des entsprechenden Methylesters vom Fp. 176°C erhalten.

- 35   Beispiel 2 – Herstellung von 5-Methyl-6-(2,6-difluor,4-aminocarbonylphenyl)-7-(4-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

- 40   Stufe 2a: 5-(Dimethylmalon-2-yl)-6-(2,6-difluor,4-cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

Eine Lösung von 1 g (2,7 mmol) 5-Chlor-6-(2,6-difluor,4-cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [vgl. WO 03/80615] und 1 g Natriumdimethylmalonat (6,5 mmol) in 10 ml Acetonitril wurden 4 Stunden bei 70-80°C und 2,5  
5 Tage bei 20-25°C gerührt. Dabei fiel ein gelber Festkörper aus. Man filtrierte die Reaktionsmischung über Kieselgur ab und rührte den Niederschlag mit einer Mischung aus verd. Salzsäure und Methylenchlorid bis zur Entfärbung. Nach Phasentrennung extrahierte man die wässrige Phase mit Methylenchlorid. Nach Trocknung der vereinigten organischen Phasen und Abdestillieren des Lösungsmittels blieb 1 g der Titelverbin-  
10 dung zurück.

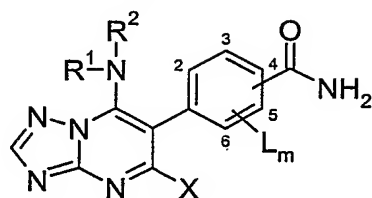
<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm): 8,4 (s, 1H); 7,4 (d, 2H); 4,65 (s, 1H); 3,7 /s, 6H); 3,55 (d, breit, 2H); 3,8 (t, breiet, 2H); 1,65 (d, breit, 2H); 1,55 (m, 1H); 1,3 (m, 2H); 0,95 (d, 3H).

15 Stufe 2b: 5-Methyl-6-(2,6-difluor,4-aminocarbonylphenyl)-7-(4-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

Eine Lösung von 0,5 g (1,03 mmol) 5-(Dimethylmalon-2-yl)-6-(2,6-difluor,4-cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin und 0,3 g (3,8 mmol)  
20 50 %ige Natronlauge in 6 ml Methanol/Wasser (5:1) wurde 3 Std. refluxiert. Nach Verdünnen mit Methyl-t-butylether (MTBE) und verdünnter Salzsäure wurde die organische Phase abgetrennt und die wässrige Phase mit MTBE extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Der Rückstand wurde mittels präparativer MPLC über Kieselgel RP-18 mit Acetonitril/Wasser-  
25 Gemischen gereinigt. Aus dem Eluat blieben nach Abtrennung des Lösungsmittels 0,11 g der Titelverbindung als gelbes Harz zurück.

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm): 8,35 (s, 1H); 7,8 (d, 2H); 7,7 (s, breit, 1H); 6,75 (s, breit, 1H); 3,65 (d, 2H); 2,8 (t, 2H); 2,35 (s, 3H); 1,6 (d, 2H); 1,5 (m, 1H); 1,3 (m, 2H); 0,9 (d,  
30 3H).

Tabelle I – Verbindungen der Formel I



I

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	L <sub>m</sub>	Position CONH <sub>2</sub>	Phys. Daten (Fp [°C]; <sup>1</sup> H-NMR δ [ppm]))
I-1	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2,6-F <sub>2</sub>	4	197
I-2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub>	2,6-F <sub>2</sub>	4	(Bsp. 2b)
I-3	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2-F	4	8,4 (s); 7,7 (m); 7,4 (t); 0,95 (d)
I-4	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4	130
I-5	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2-CH <sub>3</sub>	4	162-164
I-6	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4	240-241
I-7	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	2-CH <sub>3</sub>	4	184
I-8	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2-Cl,5-OCH <sub>3</sub>	4	190-191
I-9	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2,5-Cl <sub>2</sub>	4	198-199
I-10	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2-CH <sub>3</sub> ,5-F	4	215-216
I-11	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	2-CH <sub>3</sub> ,5-F	4	214-215
I-12	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2-CH <sub>3</sub> ,5-Cl	4	223-225
I-13	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	2-CH <sub>3</sub> , 5-OCH <sub>3</sub>	4	2 Atropisomere: 8,45; 8,4 (2s, 1H); 8,3; 8,35 (2s, 1H); 7,25; 7,1 (2s, 1H); 1,1; 1,0 (2d, 3H)
I-14	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2-Cl	4	247-249
I-15	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	2-Cl	4	2 Atropisomere: 8,35 (s, 1H); 8,15 (d, 1H); 7,95 (m, 1H); 7,55; 7,5 (2d, 1H); 1,05; 0,9 (2d, 3H)
I-16	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	2-CH <sub>3</sub> ,5-Cl	4	2 Atropisomere: 8,35 (s, 1H); 7,95; 7,9 (2s, 1H); 7,4; 7,35 (2s, 1H); 1,0 (d, 3H)



## 47

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	L <sub>m</sub>	Position CONH <sub>2</sub>	Phys. Daten (Fp [°C]; <sup>1</sup> H-NMR δ [ppm])
I-17	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2-Cl,5-CH <sub>3</sub>	4	205-208
I-18	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	2-Cl,5-CH <sub>3</sub>	4	> 250
I-19	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	2-CH <sub>3</sub>	5	> 250
I-20	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2-Cl	5	8,3 (s); 8,0 (s); 7,9 (d); 7,5 (d); 0,9 (d)
I-21	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2-CH <sub>3</sub>	5	223
I-22	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	5	246-247
I-23	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	2-Cl	5	2 Atropisomere: 8,4; 8,3 (2s, 1H); 8,2 (2s, 1H); 8,1; 8,03 (2d, 1H); 7,65 (d, 1H); 1,05; 0,95 (2d, 3H)
I-24	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	5	Polares (HPLC) A- trop-Isomer: 8,35 (s, 1H); 8,1 (s, 1H); 7,0 (s, 1H); 0,95 (d, 3H)
I-25	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	5	Unpolares (HPLC) Atrop-Isomer: 8,35 (s, 1H); 8,15 (s, 1H); 7,0 (s, 1H); 0,95 (d, 3H)

## Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

- 5 Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden als eine Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netz-  
 10 mittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Netzfleckenkrankheit der Gerste verursacht durch *Pyrenophora teres*

5 Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte „Hanna“ wurden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Versuchspflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Pyrenophora [syn. Drechs-*  
10 *lera] teres*, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 95 bis 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 6 Tagen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

15 In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Verbindungen I-1, bzw. I-25 behandelten Pflanzen nur etwa 3 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen Rebenperonospora verursacht durch *Plasmopara viticola*

20 Blätter von Topfreben der Sorte "Riesling" wurden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Unterseiten der Blätter mit einer wässrigen Zoosporenaufschwemmung von *Plasmopara viticola* inokuliert. Danach wurden die Reben zunächst für 48 Stunden in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei 24°C und anschließend für  
25 5 Tage im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16 Stunden in eine feuchte Kammer gestellt. Dann wurde das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blattunterseiten visuell ermittelt.

30 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Titelverbindung aus Beispiel 1 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 3 - Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea* bei protektiver Anwendung

35 Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 2 bis 3 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die  $1,7 \times 10^6$   
40 Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomazlösung enthielt, inokuliert. Anschließend

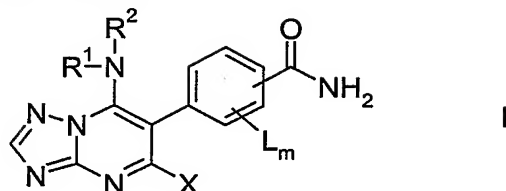
## 49

wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C, Dunkelheit und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

- 5 In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Verbindungen I-2, I-14, I-23, I-24, bzw. I-25 behandelten Pflanzen nicht mehr als 30 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 75 % befallen waren.

## Patentansprüche

## 1. Triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10  $R^1, R^2$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogencycloalkyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkenyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogencycloalkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkynyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

15  $R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclus oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkenyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkenyloxy, (exo)- $C_1$ - $C_6$ -Alkylen und Oxy- $C_1$ - $C_3$ -alkylenoxy tragen kann;

25  $R^1$  und/oder  $R^2$  können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen  $R^a$  tragen:

30  $R^a$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di- $C_1$ - $C_6$ -alkylamino,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkenyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkenyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkynyl,  $C_3$ - $C_6$ -Alkinyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkinyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyloxy, Oxy- $C_1$ - $C_3$ -alkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

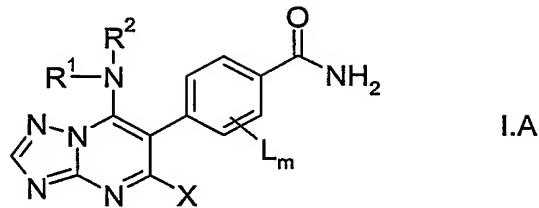
35

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen  $R^b$  tragen können:

- 5  $R^b$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocabonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkyl-
- 10 amino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;
- 15 und/oder einen bis drei der folgenden Reste:
- 20 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl- $C_1$ - $C_6$ -alkoxy, Aryl- $C_1$ - $C_6$ -alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein
- 25 können;
- L Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Alkenyloxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl;
- 30 m 1, 2, 3 oder 4, wobei die Gruppen L verschieden sein können, wenn m größer als 1 ist;
- X Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkoxy.
- 35 2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der  $R^1$  nicht Wasserstoff bedeutet.

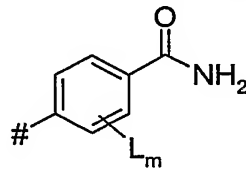
52

## 3. Verbindungen der Formel I.A:

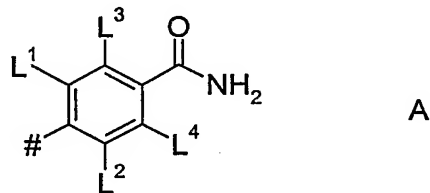


in der die Variablen gemäß Anspruch 1 definiert sind.

## 5 4. Verbindungen der Formel I.A gemäß Anspruch 3, in der die Phenylgruppe



der Gruppe A entspricht:



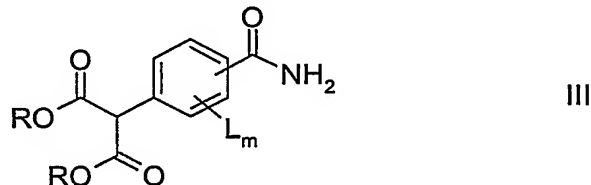
wobei

- 10  $L^1$  Halogen, Halogenmethyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl;  
 $L^2, L^3, L^4$  Wasserstoff oder Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy bedeuten.

- 15 5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II

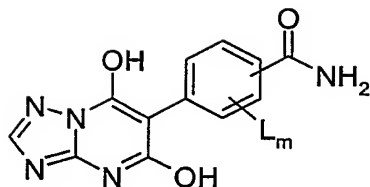


mit Phenymalonaten der Formel III,



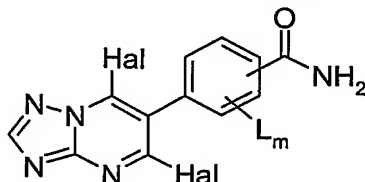
- 20 in der R für Alkyl steht, zu Dihydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV,

53



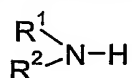
IV

Halogenierung zu den Dihalogenverbindungen der Formel V,



V

und Umsetzung von V mit Aminen der Formel VI



VI

5

zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, gewünschtenfalls zu Herstellung von Verbindungen I, in denen X für Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy steht, Umsetzung von Verbindungen I, in denen X Halogen bedeutet, mit Verbindungen der Formel VII,

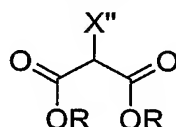
10

M-X'

VII

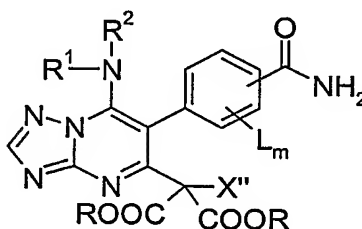
die, je nach der einzuführenden Gruppe X', ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat oder ein Halogenalkoxylat darstellen und in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallkation steht und, gewünschtenfalls, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Alkyl steht, durch Umsetzung der Verbindungen I, in denen X für Halogen steht, mit Malonaten der Formel VIII,

15



VIII

in der X'' Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl und R C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeuten, zu Verbindungen der Formel IX



IX

20

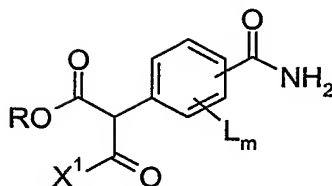
und Decarboxylierung zu Verbindungen I, in denen X für Alkyl steht.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht, durch Umsetzung von

25

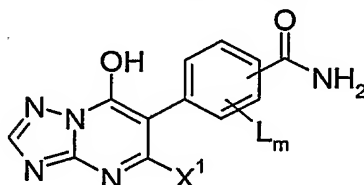
5-Aminotriazol der Formel II gemäß Anspruch 5 mit Ketoestern der Formel IIIa,

54



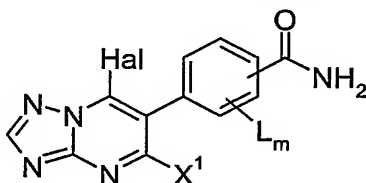
IIIa

in der  $X^1$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl und R für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht, zu 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidinen der Formel IVa



IVa

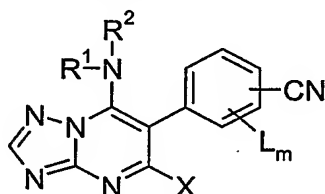
5 Halogenierung von IVa zu 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel Va



Va

und Umsetzung von Va mit Aminen der Formel VI gemäß Anspruch 5 zu Verbindungen I, in denen X für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl steht.

- 10 7. Verbindungen der Formeln IV, IVa, V und Va gemäß Ansprüchen 5 und 6.
8. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, durch Umsetzung von 6-Cyanophenyl-Triazolopyrimidinen der Formel XI



XI

- 15 in Anwesenheit von Schwefelsäure oder im Polyethylenglycol / NaOH –System oder mit Harnstoff / Wasserstoffperoxid.
9. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1
- 20 10. Saatgut, enthaltend 1 bis 1000 g einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 pro 100 kg.
- 25 11. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materi-



alien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2004/014393

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D487/04 A01N43/90  
 //(C07D487/04, 249:00, 239:00)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 03/080615 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETNER, CARSTEN; MUE) 2 October 2003 (2003-10-02) cited in the application page 18, line 45 - page 19, line 1; claims -----	1-11
A	WO 03/080614 A (BAYER CROPS SCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; BOIE, CHRISTIANE; DUNKEL, RALF;) 2 October 2003 (2003-10-02) claims; table 1 -----	1-7, 9-11
A	WO 99/41255 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 19 August 1999 (1999-08-19) cited in the application claims -----	1-7, 9-11
	----- -/-	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

## \* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

17 May 2005

Date of mailing of the international search report

27/05/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Hass, C

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2004/014393

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 98/46608 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 22 October 1998 (1998-10-22) cited in the application claims	1-7,9-11
A	----- EP 0 071 792 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 16 February 1983 (1983-02-16) cited in the application claims 1,6	1,9
A	----- US 5 994 360 A (PFRENGLE ET AL) 30 November 1999 (1999-11-30) cited in the application claims 1,4	1,9
A	----- EP 0 770 615 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 2 May 1997 (1997-05-02) cited in the application the whole document	5
P,X	----- WO 2004/041824 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETNER, CARSTEN; MUE) 21 May 2004 (2004-05-21) Seite 33, Nr. I-61 und I-62; claims 1,6-10	1-5,7,9, 11

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/014393

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
WO 03080615	A	02-10-2003	AU	2003215664 A1		08-10-2003
			BR	0308529 A		01-02-2005
			CA	2479766 A1		02-10-2003
			WO	03080615 A1		02-10-2003
			EP	1490372 A1		29-12-2004
			HR	20040985 A2		31-12-2004
WO 03080614	A	02-10-2003	DE	10212886 A1		02-10-2003
			AU	2003212322 A1		08-10-2003
			WO	03080614 A2		02-10-2003
			EP	1490370 A2		29-12-2004
WO 9941255	A	19-08-1999	US	6020338 A		01-02-2000
			AT	255110 T		15-12-2003
			AU	750489 B2		18-07-2002
			AU	2595299 A		30-08-1999
			BR	9907863 A		24-10-2000
			CA	2320304 A1		19-08-1999
			CN	1114606 C		16-07-2003
			CZ	20002933 A3		17-04-2002
			DE	69913104 D1		08-01-2004
			DE	69913104 T2		17-06-2004
			DK	1054888 T3		05-04-2004
			EP	1359150 A2		05-11-2003
			EP	1054888 A1		29-11-2000
			ES	2212527 T3		16-07-2004
			HU	0100885 A2		28-06-2001
			JP	3423290 B2		07-07-2003
			JP	2002503664 T		05-02-2002
			NZ	506247 A		28-03-2003
			PL	342576 A1		18-06-2001
			PT	1054888 T		27-02-2004
			SI	1054888 T1		30-04-2004
			WO	9941255 A1		19-08-1999
WO 9846608	A	22-10-1998	AT	239727 T		15-05-2003
			AU	735730 B2		12-07-2001
			AU	6867198 A		11-11-1998
			BG	64197 B1		30-04-2004
			BG	103805 A		30-06-2000
			BR	9808531 A		23-05-2000
			CA	2287470 A1		22-10-1998
			CN	1104433 C		02-04-2003
			CZ	9903596 A3		17-05-2000
			DE	69814375 D1		12-06-2003
			DE	69814375 T2		24-12-2003
			DK	975635 T3		02-06-2003
			EA	2906 B1		31-10-2002
			EE	9900486 A		15-06-2000
			EP	0975635 A1		02-02-2000
			ES	2199436 T3		16-02-2004
			HU	0001993 A2		28-10-2000
			ID	24182 A		13-07-2000
			IL	132238 A		29-05-2003
			JP	2001520650 T		30-10-2001
			NO	994973 A		13-10-1999
			NZ	500143 A		29-06-2001
			OA	11203 A		21-05-2003

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/014393

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9846608	A		PL 336164 A1 PT 975635 T SI 975635 T1 SK 141499 A3 TR 9902552 T2 TW 460476 B WO 9846608 A1 ZA 9803054 A	05-06-2000 30-09-2003 31-10-2003 11-09-2001 22-05-2000 21-10-2001 22-10-1998 11-10-1999
EP 0071792	A	16-02-1983	DE 3130633 A1 AT 11539 T AU 553663 B2 AU 8665982 A CA 1180329 A1 CS 226748 B2 DD 202093 A5 DE 3262143 D1 DK 341682 A , B, EP 0071792 A2 GR 76193 A1 HU 188325 B IE 53269 B1 JP 1634879 C JP 2061955 B JP 58043974 A US 4567263 A ZA 8205498 A	17-02-1983 15-02-1985 24-07-1986 10-02-1983 01-01-1985 16-04-1984 31-08-1983 14-03-1985 02-02-1983 16-02-1983 03-08-1984 28-04-1986 28-09-1988 20-01-1992 21-12-1990 14-03-1983 28-01-1986 27-07-1983
US 5994360	A	30-11-1999	NONE	
EP 0770615	A	02-05-1997	AT 243211 T BR 9605258 A CA 2188905 A1 DE 69628712 D1 DE 69628712 T2 DK 770615 T3 EP 0770615 A1 ES 2202419 T3 HU 9602957 A2 IL 119496 A JP 9124651 A PT 770615 T RU 2147584 C1 SG 55239 A1 SI 770615 T1 SK 137796 A3 TR 970386 A2 US 5808066 A ZA 9608957 A	15-07-2003 21-07-1998 28-04-1997 24-07-2003 29-04-2004 14-07-2003 02-05-1997 01-04-2004 30-06-1997 24-07-2001 13-05-1997 31-10-2003 20-04-2000 21-12-1998 31-12-2003 07-05-1997 21-05-1997 15-09-1998 24-04-1998
WO 2004041824	A	21-05-2004	AU 2003279353 A1 WO 2004041824 A2	07-06-2004 21-05-2004

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D487/04 A01N43/90  
 //(C07D487/04, 249:00, 239:00)

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 03/080615 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETNER, CARSTEN; MUE) 2. Oktober 2003 (2003-10-02) in der Anmeldung erwähnt Seite 18, Zeile 45 – Seite 19, Zeile 1; Ansprüche	1-11
A	WO 03/080614 A (BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; BOIE, CHRISTIANE; DUNKEL, RALF;) 2. Oktober 2003 (2003-10-02) Ansprüche; Tabelle 1	1-7, 9-11
A	WO 99/41255 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 19. August 1999 (1999-08-19) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche	1-7, 9-11
	----- -/-	



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

17. Mai 2005

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

27/05/2005

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Hass, C

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 98/46608 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 22. Oktober 1998 (1998-10-22) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche -----	1-7,9-11
A	EP 0 071 792 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 16. Februar 1983 (1983-02-16) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,6 -----	1,9
A	US 5 994 360 A (PFRENGLE ET AL) 30. November 1999 (1999-11-30) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,4 -----	1,9
A	EP 0 770 615 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 2. Mai 1997 (1997-05-02) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument -----	5
P,X	WO 2004/041824 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETNER, CARSTEN; MUE) 21. Mai 2004 (2004-05-21) Seite 33, Nr. I-61 und I-62; Ansprüche 1,6-10 -----	1-5,7,9, 11

# INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/014393

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 03080615 A	02-10-2003	AU 2003215664 A1	08-10-2003
		BR 0308529 A	01-02-2005
		CA 2479766 A1	02-10-2003
		WO 03080615 A1	02-10-2003
		EP 1490372 A1	29-12-2004
		HR 20040985 A2	31-12-2004
WO 03080614 A	02-10-2003	DE 10212886 A1	02-10-2003
		AU 2003212322 A1	08-10-2003
		WO 03080614 A2	02-10-2003
		EP 1490370 A2	29-12-2004
WO 9941255 A	19-08-1999	US 6020338 A	01-02-2000
		AT 255110 T	15-12-2003
		AU 750489 B2	18-07-2002
		AU 2595299 A	30-08-1999
		BR 9907863 A	24-10-2000
		CA 2320304 A1	19-08-1999
		CN 1114606 C	16-07-2003
		CZ 20002933 A3	17-04-2002
		DE 69913104 D1	08-01-2004
		DE 69913104 T2	17-06-2004
		DK 1054888 T3	05-04-2004
		EP 1359150 A2	05-11-2003
		EP 1054888 A1	29-11-2000
		ES 2212527 T3	16-07-2004
		HU 0100885 A2	28-06-2001
		JP 3423290 B2	07-07-2003
		JP 2002503664 T	05-02-2002
		NZ 506247 A	28-03-2003
		PL 342576 A1	18-06-2001
		PT 1054888 T	27-02-2004
		SI 1054888 T1	30-04-2004
		WO 9941255 A1	19-08-1999
WO 9846608 A	22-10-1998	AT 239727 T	15-05-2003
		AU 735730 B2	12-07-2001
		AU 6867198 A	11-11-1998
		BG 64197 B1	30-04-2004
		BG 103805 A	30-06-2000
		BR 9808531 A	23-05-2000
		CA 2287470 A1	22-10-1998
		CN 1104433 C	02-04-2003
		CZ 9903596 A3	17-05-2000
		DE 69814375 D1	12-06-2003
		DE 69814375 T2	24-12-2003
		DK 975635 T3	02-06-2003
		EA 2906 B1	31-10-2002
		EE 9900486 A	15-06-2000
		EP 0975635 A1	02-02-2000
		ES 2199436 T3	16-02-2004
		HU 0001993 A2	28-10-2000
		ID 24182 A	13-07-2000
		IL 132238 A	29-05-2003
		JP 2001520650 T	30-10-2001
		NO 994973 A	13-10-1999
		NZ 500143 A	29-06-2001
		OA 11203 A	21-05-2003



# INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/014393

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9846608	A	PL 336164 A1	05-06-2000
		PT 975635 T	30-09-2003
		SI 975635 T1	31-10-2003
		SK 141499 A3	11-09-2001
		TR 9902552 T2	22-05-2000
		TW 460476 B	21-10-2001
		WO 9846608 A1	22-10-1998
		ZA 9803054 A	11-10-1999
EP 0071792	A 16-02-1983	DE 3130633 A1	17-02-1983
		AT 11539 T	15-02-1985
		AU 553663 B2	24-07-1986
		AU 8665982 A	10-02-1983
		CA 1180329 A1	01-01-1985
		CS 226748 B2	16-04-1984
		DD 202093 A5	31-08-1983
		DE 3262143 D1	14-03-1985
		DK 341682 A , B,	02-02-1983
		EP 0071792 A2	16-02-1983
		GR 76193 A1	03-08-1984
		HU 188325 B	28-04-1986
		IE 53269 B1	28-09-1988
		JP 1634879 C	20-01-1992
		JP 2061955 B	21-12-1990
		JP 58043974 A	14-03-1983
		US 4567263 A	28-01-1986
		ZA 8205498 A	27-07-1983
US 5994360	A 30-11-1999	KEINE	
EP 0770615	A 02-05-1997	AT 243211 T	15-07-2003
		BR 9605258 A	21-07-1998
		CA 2188905 A1	28-04-1997
		DE 69628712 D1	24-07-2003
		DE 69628712 T2	29-04-2004
		DK 770615 T3	14-07-2003
		EP 0770615 A1	02-05-1997
		ES 2202419 T3	01-04-2004
		HU 9602957 A2	30-06-1997
		IL 119496 A	24-07-2001
		JP 9124651 A	13-05-1997
		PT 770615 T	31-10-2003
		RU 2147584 C1	20-04-2000
		SG 55239 A1	21-12-1998
		SI 770615 T1	31-12-2003
		SK 137796 A3	07-05-1997
		TR 970386 A2	21-05-1997
		US 5808066 A	15-09-1998
		ZA 9608957 A	24-04-1998
WO 2004041824	A 21-05-2004	AU 2003279353 A1	07-06-2004
		WO 2004041824 A2	21-05-2004